

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
21. Oktober 2004 (21.10.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/089872 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07C 217/62, A61K 31/135, C07C 213/10, A61P 13/00
- (74) Gemeinsamer Vertreter: SCHWARZ PHARMA AG; Schacht, D., W., Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim (DE).
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/003567
- (22) Internationales Anmeldedatum: 3. April 2004 (03.04.2004)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
103 15 917.7 8. April 2003 (08.04.2003) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): SCHWARZ PHARMA AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BREITENBACH, Armin [DE/DE]; Opladener Strasse 108, 40789 Monheim (DE). MEESE, Claus [DE/DE]; Kreuzberger Str. 50, 40789 Monheim (DE). WOLFFE, Hans-Michael [DE/DE]; Richard-Wagner-Strasse 2, 40789 Monheim (DE). DREWS, Roland [DE/DE]; Ulmenweg 24, 40789 Monheim (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

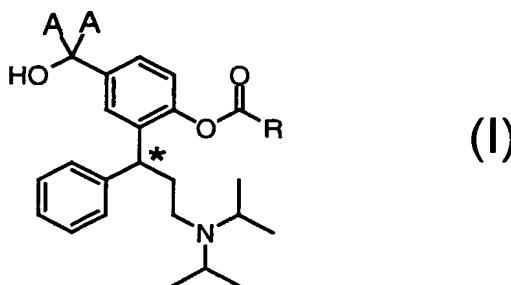
Erklärungen gemäß Regel 4.17:

- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: HIGHLY PURE BASES OF 3,3-DIPHENYL PROPYLAMINE MONOESTERS

(54) Bezeichnung: HOCHREINE BASEN VON 3,3-DIPHENYLPROPYLAMINMONOESTERN



(57) Abstract: The invention relates to a compound of general formula (I) wherein A represents deuterium or hydrogen, R represents a group selected from C₁₋₆ alkyl, C₃₋₁₀ cycloalkyl or phenyl, which can be substituted by C₁₋₃ alkoxy, fluorine, chlorine, bromine, iodine, nitro, amino, hydroxyl, oxo, mercapto or deuterium. The C atom marked with a * (star) can be present in an (R) configuration, in an (S)-configuration or a mixture thereof. The invention is characterised in that the above-mentioned compounds are free bases with a degree of purity of more than 97 wt %. The invention also relates to a method for the production of highly pure compounds

of general formula (I) and to the use thereof in the production of medicaments.

WO 2004/089872 A1

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft eine Verbindung der allgemeinen Formel (I), wobei A Deuterium oder Wasserstoff ist, R für eine Gruppe steht, die ausgewählt ist aus C₁₋₆Alkyl, C₃₋₁₀Cycloalkyl oder Phenyl, die jeweils mit C₁₋₃Alkoxy, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Nitro, Amino, Hydroxy, Oxo, Mercapto oder Deuterium substituiert sein kann und wobei das mit *-(Stern) markierte C-Atom in (R)-Konfiguration, in (S)-konfiguration oder als Mischung davon vorliegen kann, dadurch charakterisiert, dass die besagte Verbindung als freie Base mit einem Reinheitsgrad von über 97 Gew% vorliegt. Ferner betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung hochreiner Verbindungen der allgemeinen Formel (I) sowie die Verwendung der hochreinen Verbindungen zur Herstellung von Arzneimitteln.